

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM
GEBIET DES PATENTWESENS**

REC'D 27 MAR 2006

WIPO

PCT

PCT

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE
PATENTIERBARKEIT**

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055170/SSP	WEITERES VORGEHEN	siehe Formblatt PCT/IPEA/416
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014228	Internationales Anmelde datum (Tag/Monat/Jahr) 14.12.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 17.12.2003
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04 A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.

2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 10 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen

a. (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um

- Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).
- Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.

b. (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).

4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- Feld Nr. I Grundlage des Berichts
- Feld Nr. II Priorität
- Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erforderliche Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erforderlichen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen
- Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 11.10.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 24.03.2006
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Weisbrod, T Tel. +49 89 2399-8931

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014228

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
 - internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt*):

Beschreibung, Seiten

1-35 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-16 in der ursprünglich eingereichten Fassung

einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
 - Beschreibung: Seite
 - Ansprüche: Nr.
 - Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigefügten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c).
 - Beschreibung: Seite
 - Ansprüche: Nr.
 - Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014228

Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1. Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
 - die Ansprüche eingeschränkt.
 - zusätzliche Gebühren entrichtet.
 - zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
 - weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
 - erfüllt ist.
 - aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:
4. Daher ist der Bericht für die folgenden Teile der internationalen Anmeldung erstellt worden:
 - alle Teile.
 - die Teile, die sich auf die Ansprüche mit folgenden Nummern beziehen: .

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-16
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche 1-16 (part, inventions 1-3)
	Nein: Ansprüche 1-16 (part, inventions 4-5)
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche: 1-16
	Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:

siehe Beiblatt

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014228

Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:

siehe Beiblatt

Zu Punkt I

Grundlage des Bescheides

Die Anmeldung bezieht sich auf

- (i) 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine der Formel (I) (Ansprüche 1-6, 11),
- (ii) 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine der Formel (I.1) (Ansprüche 7, 11),
- (iii) 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine der Formel (I.2) (Ansprüche 8, 11),
- (iv) 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine der Formel (I.3) (Ansprüche 9-11),
- (v) Verfahren zur Herstellung von Verbindungen (I) (Ansprüche 12 und 13),
- (vi) Mittel, die Verbindungen (I) enthalten (Anspruch 14),
- (vii) Saatgut, das Verbindungen (I) enthält (Anspruch 15) und
- (viii) Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, welches sich auf Verbindungen (I) bezieht (Anspruch 16).

Zu Punkt IV

Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1 Es wird auf folgende Dokumente verwiesen.

- D1: WO 99/48893 A, 30. September 1999; in der Anmeldung erwähnt.
- D2: US-A-5 981 534, 9. November 1999.
- D3: US-B1-6 204 269, 20. März 2001.
- D4: US-A-5 994 360, 30. November 1999.
- D5: WO 02/38565 A, 16. Mai 2002; in der Anmeldung erwähnt.
- D6: WO 02/083677 A, 24. Oktober 2002; in der Anmeldung erwähnt.
- D7: WO 03/008417 A, 30. Januar 2003.

2 Die Patentanmeldung erfüllt nicht das Erfordernis der Einheitlichkeit, da der beanspruchte Schutzgegenstand sich nicht auf eine sondern auf fünf mögliche Erfindungen bezieht, welche nicht durch eine einzige allgemeine erfinderische Idee verbunden sind (Regel 13.1 und 13.2 PCT). Die verschiedenen Erfindungen bzw. Gruppen von Erfindungen sind in der von der Anmelderin gewählten Reihenfolge:

- (1) Ansprüche 1-2, 6-12, 14-16 (teilweise) und Anspruch 3 (ganz) sich beziehend auf Verbindungen (I) bis (I.3) mit X gleich Cyano, sowie Gegenstände, die sich

auf solche Verbindungen beziehen;

- (2) Ansprüche 1, 6-11, 14-16 (teilweise) und Ansprüche 4 und 13 (ganz) sich beziehend auf Verbindungen (I) bis (I.3) mit X gleich C₁-C₄-Alkyl, sowie Gegenstände, die sich auf solche Verbindungen beziehen;
- (3) Ansprüche 1-2, 6-12, 14-16 (teilweise) und Anspruch 5 (ganz) sich beziehend auf Verbindungen (I) bis (I.3) mit X gleich C₁-C₄-Alkoxy, sowie Gegenstände, die sich auf solche Verbindungen beziehen;
- (4) Ansprüche 1-2, 6, 11-12, 14-16 (teilweise) sich beziehend auf Verbindungen (I) mit X gleich C₃-C₄-Alkenyloxy und C₃-C₄-Halogenalkenyloxy, sowie Gegenstände, die sich auf solche Verbindungen beziehen;
- (5) Ansprüche 1-2, 6, 11-12, 14-16 (teilweise) sich beziehend auf Verbindungen (I) mit X gleich C₁-C₂-Halogenalkoxy, sowie Gegenstände, die sich auf solche Verbindungen beziehen.

Als einziges gemeinsames technisches Merkmal enthalten die genannten möglichen Erfindungen die Struktur eines "5-substituierten 6-(2-Fluor-4-alkoxy-phenyl)triazolopyrimidins". Dieses technische Merkmal kann jedoch nicht als "besonderes technisches Merkmal" betrachtet werden, da es keinen Beitrag zum Stand der Technik leistet. Die Dokumente **D1** bis **D3** und **D5** offenbaren bereits 5-Halogeno-substituierte 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine und ihre Verwendung als Pflanzenfungizide (**D1**, Anspruch 1, Beispiele 3 und 44; **D2**, Anspruch 1, Beispiele; **D3**, Anspruch 1; Beispiel 17; **D5**, Seite 21, Beispiele I-16 bis I-18). Zudem lehrt **D5** bereits, dass Cyano-, C₁-C₄-Alkyl- und C₁-C₄-Alkoxy-Gruppen in Position 5 mit der pflanzenfungiziden Wirkung von 6-(substituiertes Phenyl)triazolopyrimidinen kompatibel ist (**D5**, Anspruch 1). Ausgehend insbesondere von **D5** kann die der Anmeldung zu Grunde liegende Aufgabe in der Bereitstellung beziehungsweise Selektion weiterer 5-substituierter 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine mit pflanzenfungizider Wirkung gesehen werden; und im Lichte von **D5** sind die möglichen Beiträge der Anmeldung zum Stand der Technik:

- (a) die Bereitstellung beziehungsweise Selektion weiterer pflanzenfungizider 5-substituierter 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine durch Austausch des

5-Chlor-Substituenten der Beispiele I-16 bis I-18 von **D5** durch eine (X)Cyano-Gruppe;

- (b) die Bereitstellung beziehungsweise Selektion weiterer pflanzenfungizider 5-substituierter 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine durch Austausch des 5-Chlor-Substituenten der Beispiele I-16 bis I-18 von **D5** durch eine (X)C₁-C₄-Alkyl-Gruppe;
- (c) die Bereitstellung beziehungsweise Selektion weiterer pflanzenfungizider 5-substituierter 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine durch Austausch des 5-Chlor-Substituenten der Beispiele I-16 bis I-18 von **D5** durch eine (X)C₁-C₄-Alkoxy-Gruppe;
- (d) die Bereitstellung weiterer pflanzenfungizider 5-substituierter 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine durch Austausch des 5-Chlor-Substituenten der Beispiele I-16 bis I-18 von **D5** durch eine ungesättigte Ether-Gruppe (X = C₃-C₄-Alkenyloxy und C₃-C₄-Halogenalkenyloxy); sowie
- (e) die Bereitstellung weiterer pflanzenfungizider 5-substituierter 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine durch Austausch des 5-Chlor-Substituenten der Beispiele I-16 bis I-18 von **D5** durch eine gesättigte, halogenierte Ether-Gruppe (X = C₁-C₂-Halogenalkoxy).

Ausgehend von **D5** divergieren die genannten Beiträge jedoch in fünf verschiedene Richtungen, so dass zwischen ihnen kein auf einer einzigen erfinderischen Idee basierender technischer Zusammenhang besteht, der die Einheitlichkeit der Patentanmeldung unterstützen würde.

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1 Neuheit

Die vorliegenden Verbindungen unterscheiden sich von den 5-Halogeno-substituierten 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidinen der Dokumente **D1** bis **D3**

hinsichtlich ihres 5-Substituenten X. Der Schutzgegenstand der Anmeldung ist somit gegenüber **D1** bis **D3** neu.

D4 offenbart 5(X)-Alkyl-substituierte 6-(n-mal L-substituierte Phenyl)triazolo-pyrimidine, welche die vorliegenden Verbindungen (I) generell umfassen. **D4** offenbart jedoch nicht spezifisch Verbindungen (I), deren Phenylgruppe eine 4-Alkoxy-Gruppe trägt. Der Schutzgegenstand der Anmeldung kann somit als neue Auswahl aus der Lehre von **D4** mit der 4-OR³-Gruppe der vorliegenden Verbindungen (I) als neues technisches Merkmal betrachtet werden.

D5 zeigt ähnliche 5-Halogen-, Cyano-, Alkyl- und Alkoxy-substituierte 6-(n-mal R⁴-substituierte Phenyl)triazolopyrimidine, welche die vorliegenden Verbindungen (I) bereits zum Teil umfassen. **D5** offenbart jedoch nicht spezifisch Verbindungen (I) mit den vorliegenden 5(X)-Substituenten. Somit kann der Schutzgegenstand der Anmeldung als neue Auswahl aus der Lehre von **D5** mit der Bedeutung von X als neues technisches Merkmal betrachtet werden.

D6 bezieht sich auf 5-Cyano- und Alkoxy-substituierte 6-(2-Chlor-6-Fluorphenyl)-triazolopyrimidine, von denen sich die vorliegenden Verbindungen durch ihre zusätzliche 4-OR³-Gruppe unterscheiden. Der Schutzgegenstand der Anmeldung ist somit gegenüber **D6** neu.

D7 bezieht sich auf 6-(2-Methylphenyl)triazolopyrimidine, von denen sich die vorliegenden Verbindungen durch ihre Phenyl-Substituenten unterscheiden. Der Schutzgegenstand der Anmeldung ist somit gegenüber **D7** neu.

Die Anmeldung scheint somit das Neuheitskriterium zu erfüllen.

2 Erfinderische Tätigkeit

2.1 Die Anmeldung beschreibt die Herstellung von wenigen Beispielen der Formel (I) (X = CN, Me, OMe, O-n-Bu) und beschreibt, dass solche Verbindungen gegen bestimmte Schadpilze wirksam sind (die Anmeldung, Seiten 32-35). Gegenwärtig wird **D5** als nächstliegender Stand der Technik angesehen, da bestimmte vorliegende Verbindungen (I) – nämlich die, der Aspekte (1) bis (3) gemäss Punkt IV.2 dieses Bescheids – bereits in **D5** generell umfasst sind, und die der Aspekte (4) und (5) sich von den Verbindungen aus **D5** lediglich durch jeweils eine strukturelle Modifikation

unterscheiden. Ausgehend von **D5** kann die der Anmeldung zu Grunde liegende Aufgabe in der Bereitstellung beziehungsweise Selektion weiterer 5-substituierter 6-(2-Fluor-4-alkoxyphenyl)triazolopyrimidine mit pflanzenfungizider Wirkung gesehen werden.

2.2 Erfindungen (1) bis (3) gemäss Punkt IV.2 dieses Bescheids

Verbindungen (I) gemäss den Aspekten (1) bis (3) stellen jeweils eine neue Auswahl der Lehre von **D5** dar (siehe Punkt V.1 oben). Infolgedessen würde es sich bei den Verbindungen (I) der Aspekte (1) bis (3) a priori nur um naheliegende Alternativen zu den Verbindungen von **D5** handeln. Allerdings konnte die Anmelderin während des Internationalen vorläufigen Prüfungsverfahren nachweisen, dass Verbindungen (I) der Aspekte (1) bis (3) im Vergleich zu den strukturell ähnlichen 5-Chlorverbindungen von **D5** eine überlegene fungizide Aktivität aufweisen.

Infolgedessen scheint den Aspekten (1) bis (3) der Anmeldung eine erfinderische Tätigkeit zugrunde zu liegen.

2.3 Mögliche Erfindungen (4) und (5) gemäss Punkt IV.2 dieses Bescheids

Verbindungen (I) gemäss den Aspekten (4) und (5) unterscheiden sich von den Verbindungen aus **D5** dadurch, dass sie in Position 5 eine C₃-C₄-Alkenyloxy- (Aspekt 4) beziehungsweise eine C₁-C₂-Halogenalkoxy-Gruppe (Aspekt 5) anstelle einer C₁-C₄-Alkoxy-Gruppe tragen. **D7** zeigt jedoch bereits, dass 5-Alkenyloxy- und 5-Haloalkoxy-Gruppen mit der gewünschten fungiziden Wirkung von Triazolopyrimidinen kompatibel ist (**D7**, Anspruch 1). Ausgehend von **D5** in Kombination mit **D7** handelt es sich demzufolge bei den Verbindungen (I) der Aspekte (4) und (5) lediglich um naheliegende Alternativen zu den Verbindungen von **D5**, für die ohne nachgewiesene, unerwartete Eigenschaft gegenüber der jeweils strukturell ähnlichen Verbindung aus **D5** keine erfinderische Tätigkeit anerkannt würde (für Aspekt (4): vorliegende Verbindung (I) mit R¹ = Et, R² = H, R³ = Me, L = F, X = O-CH₂-CH=CH₂ im Vergleich mit I-16 von **D5**; für Aspekt (5): vorliegende Verbindung (I) mit R¹ = Et, R² = H, R³ = Me, L = F, X = OCH₂Cl im Vergleich mit I-16 von **D5**).

Sollte die Anmelderin jedoch wirklich überzeugende Argumente vorbringen, dass

bestimmte Verbindungen der Aspekte (4) und/oder (5) nicht aus dem zitierten Stand der Technik nahegelegt sind, dann wird angemerkt, dass die Anmeldung keinerlei Nachweis enthält, dass das technische Problem durch Verbindungen der Aspekte (4) und/oder (5) tatsächlich gelöst worden ist. Unter diesen Bedingungen kann nur auf Basis des allgemeinen Fachwissens anerkannt werden, dass die beanspruchten Verbindungen die gestellte technische Aufgabe wirklich lösen. Dasselbe allgemeine Fachwissen ist dann aber auch darauf anwendbar, dass die vorgeschlagene Lösung des technischen Problems naheliegend ist. Folglich würde ohne nachgewiesenen technischen Effekt der beanspruchten Verbindungen keine erfinderische Tätigkeit für die Aspekte (4) und (5) der Anmeldung anerkannt.

Zu Punkt VII

Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

In der Beschreibung ist weder der in D7 offenbare Stand der Technik noch dieses Dokument angegeben (Regel 5.1(a)(ii) PCT).

Zu Punkt VIII

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Die Ansprüche 1 und 7-9 sind als separate unabhängige Ansprüche formuliert, obwohl die Verbindungen der Ansprüche 7-9 unter den Umfang von Anspruch 1 zu fallen scheinen. Infolgedessen erfüllt der vorliegende Anspruchssatz nicht das von Artikel 6 PCT geforderte Kriterium der Knaptheit.